

**PRIORITY
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)



REC'D 09 APR 2003

WIPO

PCT

17 SEP 2004

**Prioritätsbescheinigung über die Einreichung
einer Patentanmeldung**

Aktenzeichen:

102 12 886.3

Anmeldetag:

22. März 2002

Anmelder/Inhaber:

Bayer CropScience AG,
Monheim, Rheinl/DE

Erstanmelder: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT,
Leverkusen/DE

Bezeichnung:

Triazolopyrimidine

IPC:

C 07 D, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 30. Januar 2003
Deutsches Patent- und Markenamt
Der Präsident

Im Auftrag

Fauer

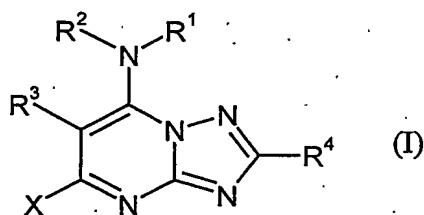
Triazolopyrimidine

Die Erfindung betrifft neue Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und
5 ihre Verwendung zur Bekämpfung von schädlichen Organismen.

Die Erfindung betrifft außerdem neue Zwischenprodukte sowie Verfahren zu ihrer
Herstellung.

Es ist bereits bekannt geworden, dass bestimmte Triazolopyrimidine fungizide
Eigenschaften besitzen (vergleiche z. B. vgl. EP 550113, WO 94-20501, EP 613900,
US 5612345, EP 834513, WO 98-46607 und WO 98-46608). Die Wirkung dieser
Verbindungen ist jedoch in vielen Fällen unbefriedigend.

Es wurden neue Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel (I),



in welcher

20 R¹ für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl,
Cyloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino,
Dialkylamino, Alkenylamino, Alkynylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-
N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocyclyl steht, und

25 R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl,
Alkynyl oder Cycloalkyl steht, oder

R^1 und R^2 gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

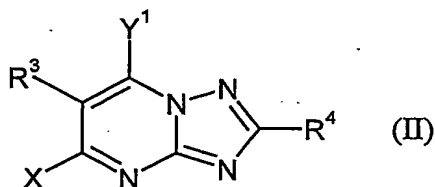
R^3 für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

R^4 für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und

X für Halogen steht, gefunden.

Weiterhin wurde gefunden, dass man die neuen Triazolopyrimidine der allgemeinen Formel (I) erhält, wenn man

a) Dihalogentriazolopyrimidine der allgemeinen Formel (II),

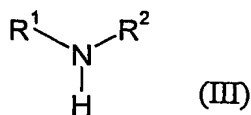


in welcher

R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y^1 für Halogen steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III),



in welcher

R^1 und R^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in
5 Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Alkyltriazolopyrimidine der allgemeinen
Formel (I) eine sehr gute Wirkung gegen Schadorganismen, insbesondere eine starke
fungizide Wirkung zeigen.

Besondere Bedeutungen der Substituenten bzw. Bereiche der in den oben und nach-
stehend aufgeführten Formeln werden im folgenden erläutert.

15 R^1 steht bevorzugt für Amino, für jeweils gegebenenfalls durch 1 bis 9
Halogenatome, Hydroxy, Alkoxy, Dialkylamino, Cyloalkyl, Cyano, Phenyl
oder Heterocyclyl substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy,
Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino,
Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino oder Alkylidenamino mit
jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten, 2 bis 6
20 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl und Alkinylnketten, 3 bis 7
Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylresten oder 2 bis 6 Kohlenstoffatomen
im Fall von Alkylidenamino oder für Heterocyclyl mit 5 oder 6 Ringgliedern.

25 Die genannten Phenyl- und Heterocyclylreste können ihrerseits einfach oder mehr-
fach, gleich oder verschieden substituiert sein.

Als Substituenten für Heterocyclyl kommen vorzugsweise in Frage:

Halogen, Phenyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy oder Alkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

5 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

Als Substituenten für Phenyl kommen vorzugsweise in Frage:

10 Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

15 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

20 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

25 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

30 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

35 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximinoalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den einzelnen Alkylteilen;

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen; oder

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R² steht bevorzugt für Wasserstoff oder für gegebenenfalls durch Halogen oder C₃-C₆-Cycloalkyl substituiertes C₁-C₄-Alkyl, C₂-C₄-Alkenyl, C₂-C₄-Alkynyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl.

R¹ und R² stehen auch bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls durch Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen oder Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Halogenatomen substituierten, 3 bis 6 gliedrigen heterocyclischen Ring.

R³ steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Phenyl, wobei als Substituenten bevorzugt folgende in Frage kommen:

Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thio-carbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyl-
oxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder ver-
schiedenen Halogenatomen;

10

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkyl-
carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylsulfonyloxy, Hydroximi-
noalkyl oder Alkoximinoalkyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den
einzelnen Alkylteilen;

15

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch
Halogen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlen-
stoffatomen und/oder geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl mit 1 bis 4
Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen
substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen oder Dioxyalkylen mit
jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen oder

20

Cycloalkyl mit 3 bis 6 Kohlenstoffatomen.

R⁴ steht bevorzugt für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls durch 1
25 bis 13 Halogenatome substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino mit jeweils 1
bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylketten.

X steht bevorzugt für Fluor, Chlor oder Brom.

R¹ steht besonders bevorzugt für Amino oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Hydroxy, Methoxy, Dimethylamino, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Dioxolan-2-yl, 2-Furyl, 2-Tetrahydrofuryl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, 2-Methylallyl, Propargyl oder

für jeweils gegebenenfalls durch Methyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Piperazinyl oder

für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Hydroxy, Methoxy, Dimethylamino, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl substituiertes Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylanimo, 1-Methoxycarbonyl-1-methylamino, Methoxy, Ethoxy oder

für jeweils gegebenenfalls substituiertes Benzyloxy, Pyridylmethoxy oder Thiazolylmethoxy.

Die genannten Pyridyl- und Thiazolylreste können auch vorzugsweise ihrerseits noch weiter substituiert sein. Als Substituenten für Pyridyl- und Thiazolyl kommen vorzugsweise infrage: Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Dichlorfluormethylthio, Trifluormethylthio, Phenyl.

Als Substituenten für Phenyl und Benzyl kommen vorzugsweise in Frage:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy,

Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl oder Trifluormethylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, Hydroximinomethyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinoethyl oder Ethoximinoethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R² steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 1-(1,1,1-Trifluormethyl)ethyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl.

R¹ und R² stehen auch besonders bevorzugt gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Hydroxy, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl substituiertes Pyrrolidinyl, Piperidinyl, Morpholinyl, Thiomorpholinyl, Piperazinyl, 3,6-Dihydro-1(2H)-pyridinyl, 3,6-Dihydro-1(2H)-pyridinyl oder Tetrahydro-1(2H)-pyridazinyl.

R³ steht besonders bevorzugt für einfach bis vierfach substituiertes Phenyl. Als Substituenten kommen besonders bevorzugt folgende in Frage:

Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Nitro, Formyl, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Allyl, Propargyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl, Allyloxy, Propargyloxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trichlorethinyloxy, Trifluorethinyloxy, Chlorallyloxy, Iodpropargyloxy, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Acetyl, Propionyl, Acetyloxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Hydroximino-methyl, Hydroximinoethyl, Methoximinomethyl, Ethoximinomethyl, Methoximinomethyl oder Ethoximinomethyl,

jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Trimethylen (Propan-1,3-diyl), Methylendioxy oder Ethylendioxy,

Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R⁴ steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Trifluormethoxy, Trifluorethoxy, Dimethylamino, Ethylmethylamino oder Diethylamino.

X steht besonders bevorzugt für Fluor oder Chlor.

R³ steht ganz besonders bevorzugt für jeweils durch Fluor und/oder Chlor in 2-Position, 2,4-Position, 2,6-Position oder 2,4,6-Position substituiertes Phenyl.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Reste-
definitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend
für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte.

- 5 Die zuvor genannten Reste-Definitionen können untereinander in beliebiger Weise
kombiniert werden. Außerdem können einzelne Definitionen entfallen.

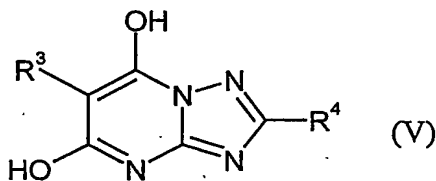
10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe
benötigten Dihalogentriazolopyrimidine sind durch die Formel (II) allgemein defi-
niert. In dieser Formel (II) haben R^3 , R^4 und X vorzugsweise, bzw. insbesondere
diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der
erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbeson-
dere bevorzugt für R^3 , R^4 und X angegeben wurden. Y^1 steht für Halogen, vorzugs-
weise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

15

Die Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (II) sind neu und ebenfalls Gegenstand
der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen eignen sich zur Bekämp-
fung von unerwünschten Mikroorganismen.

20

Sie werden erhalten (Verfahren b), wenn man Dihydroxytriazaolopyrimidine der For-
mel (V),



in welcher

25

R^3 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einem Halogenierungsmittel, wie beispielsweise Phosphortrichlorid, Phos-
phortribromid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Thionylchlorid, Thio-

nylbromid oder Gemischen daraus, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise Chlorbenzol, umgesetzt. Als Verdünnungsmittel kann auch das Halogenierungsmittel selbst, wie Phosphoroxychlorid, oder ein Halogenierungsmittelgemisch dienen.

5

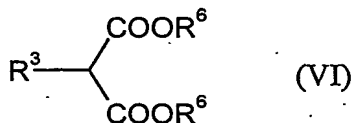
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Dihydroxytriazolopyrimidine sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben R^3 und R^4 vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^3 und R^4 angegeben wurden.

10

Die Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (V) sind neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen eignen sich zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

15

Sie werden erhalten (Verfahren c), wenn man Arylmalonester der Formel (VI),



20

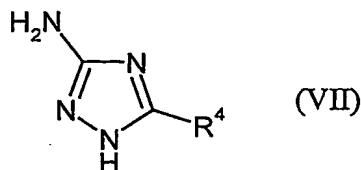
in welcher

R^3 die oben angegebene Bedeutung hat und

R^6 für Alkyl steht,

25

mit einem Aminotriazol der Formel (VII),



in welcher

R⁴ die oben angegebene Bedeutung hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, wie beispielsweise eines Alkohols und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, vorzugsweise eines tertiären Amins, wie beispielsweise Tributylamin, umgesetzt. Das als Base eingesetzte Amin kann auch gleichzeitig als Verdünnungsmittel dienen.

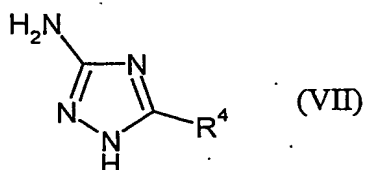
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe benötigten Arylmalonester sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (V) hat R³ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R³ angegeben wurde. R⁶ steht für Alkyl, vorzugsweise für Methyl oder Ethyl.

Die Arylmalonester der Formel (VI) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergleiche z. B. US 6156925).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens c) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Aminotriazole sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) hat R⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenige Bedeutung, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R⁴ angegeben wurde.

Die Aminotriazole der Formel (VII) sind teilweise bekannte Synthesekemikalien oder können nach bekannten Methoden hergestellt werden (vergleiche z. B. Russian Journal of Organic Chemistry, Vol. 29, N. 11, 1993, Seite 1942-1943).

5 Die Aminotriazole der Formel (VII),

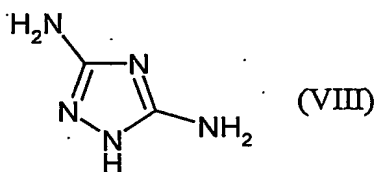


in welcher

10 R⁴ für Cyano oder Brom steht,

sind neu und Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Auch diese Verbindungen eignen sich zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

15 Sie werden erhalten, indem man Diaminotriazol der Formel (VIII)



20 zunächst diazotiert und anschließend mit einem Bromierungsmittel, wie beispielsweise Bromwasserstoff bzw. Cyanierungsmittel, wie beispielsweise Cyanwasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart weiterer Reaktionshilfsmittel umgesetzt.

25 Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens b) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenierungsmittel sind allgemein bekannte Laborchemikalien.

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R^1 und R^2 vorzugsweise, bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R^1 und R^2 angegeben wurden.

Die Amine der Formel (III) sind allgemein übliche Laborchemikalien oder können nach bekannten Methoden erhalten werden.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen Ammoniak oder tertiäre Amine infrage, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Dihalogentriazolopyrimidine der Formel (II) im allgemeinen 0,5 bis 10 mol, vorzugsweise 0,8 bis 2 mol Amin der Formel (III) ein.

Die erfindungsgemäßen Verfahren werden im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

5 Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

10 Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder
Pseudoperonospora cubensis;

15 Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

20 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

25 Podospaera-Arten, wie beispielsweise Podospaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

30

- Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus
(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
- 5 Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;
- Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
- Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;
- 10 Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;
- Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;
- Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;
- 15 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;
- Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;
- 20 Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;
- Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;
- Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;
- 25 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
- Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;
- 30 Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

5

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

10

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

15

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

20

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia-, Podosphaera-Arten, einsetzen.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, 5 Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, 10 genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

15 Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

20 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,

25 Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,

Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,

Coniophora, wie *Coniophora puetana*,

Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,

5 Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,

Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,

10 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie *Escherichia coli*,

15 Pseudomonas, wie *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, wie *Staphylococcus aureus*.

20 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

25 Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiernmitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streck-
30 mittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet

werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfractionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstengel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Cephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

5

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

10

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

15

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen in Frage:

Fungizide:

20

Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

25

Calciumpolysulfid, Carpropamid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

30

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

5

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,

10

Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenhexamid, Fenitropan, Fenpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

15

Guazatin,

Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol,

20

Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Iprovalicarb, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaledione,

25

Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid, Kupfer-naphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,

30

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomycin, Myclobutanil, Myclozolin,

Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol,

Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,

5 Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Picoxystrobin, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyraclostrobin, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,

10 Quinconazol, Quintozen (PCNB), Quinoxifen

Schwefel und Schwefel-Zubereitungen, Spiroxamine

15 Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Trifloxystrobin, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,

Uniconazol,

20 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol, Zarilamid, Zineb, Ziram sowie

Dagger G,

OK-8705,

OK-8801,

25 α -(1,1-Dimethylethyl)- β -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -fluor-b-propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(2,4-Dichlorphenyl)- β -methoxy-a-methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,
 α -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- β -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,

30 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,

- (E)-a-(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,
 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,
 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,
 5 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,
 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,
 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,
 10 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,
 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,
 15 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,
 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl-β-D-glycopyranosyl)-α-D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,
 2-Aminobutan,
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,
 20 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyantomethyl)-acetamid,
 2-Phenylphenol(OPP),
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,
 25 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,
 8-Hydroxychinolinsulfat,
 30 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,

- bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-
 hydrochlorid,
- 5 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,
 Kaliumhydrogencarbonat,
 Methantetrathiol-Natriumsalz,
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,
 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,
- 10 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,
 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
- 15 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,
 N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid,
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,
- 20 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiaazol-7-carbothioat,
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,
- 25 4-[3,4-Dimethoxyphenyl]-3-(4-fluorphenyl)-acryloyl]-morpholin

Bakterizide:

5 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oethilinin, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

10 Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,

15 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bistrifluron, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyridaben,

20 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,

25 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon, Dichlorvos, Dicofol, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn,

Eflusilanate, Emamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp.,
Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,

5 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim,
Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate,
Fipronil, Fluazuron, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron,
Flumethrin, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate,
Fubfenprox, Furathiocarb,

10 Granuloseviren

Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene,

15 Imidacloprid, Indoxacarb, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,
Kernpolyederviren

Lambda-cyhalothrin, Lufenuron

20 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae,
Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methoprene, Methomyl,
Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemy-
cin, Monocrotophos,

25 Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron

Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M

30 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A,

Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propargite, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,

5 Quinalphos,

Ribavirin

Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Sulfotep, Sulprofos,

10

Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon Thetacypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,

15

Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

20

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

25

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

30

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-imin

- 2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol
- 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion
- 5 2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid
- 10 3-Methylphenyl-propylcarbamate
- 4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol
- 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-
- 15 3(2H)-pyridazinon
- 4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-
- pyridazinon
- 20 4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon
- Bacillus thuringiensis strain EG-2348
- Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid
- 25 Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-
- ester
- [3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid
- 30

Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat

5 N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-1-carboxamid

10 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

15

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

N-Cyanomethyl-4-trifluormethyl-nicotinamid

20

3,5-Dichlor-1-(3,3-dichlor-2-propenyloxy)-4-[3-(5-trifluormethylpyridin-2-yloxy)-propoxy]-benzol

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

25

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie

30

Aspergillus niger und *Aspergillus fumigatus*, Trichophyton-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, Microsporon-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykologischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

5

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

10

15

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

20

25

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in

30

Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

5 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

10 Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß ver-
15 wendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit
20 der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die
25 gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder
30 gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte,

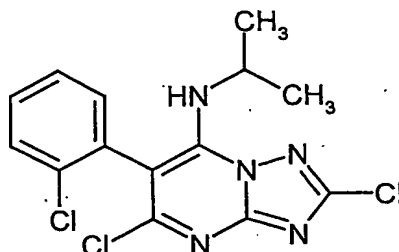
Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Han-

5 delsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

10 Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.

15 Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

20 Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Venturia-, Podosphaera-Arten, einsetzen.

HerstellungsbeispieleBeispiel 1

5 Verfahren a)

0,33 g (1,0 mmol) des 2,5,7-Trichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin werden in 10 ml Dichlorethan gelöst. Zu der Lösung wird 0,12 g (2,0 mmol) Isopropylamin und 0,1 g Triethylamin gegeben und im geschlossenen Rohr 2
 10 Stunden bei 60°C gerührt. Nach Abkühlen wird das Lösungsmittel im Vakuum entfernt und der Rückstand säulenchromatographisch an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester 1:1) gereinigt. Man erhält 0,11 g (18 % der Theorie, 65 % Reinheit) N-[2,5-Dichloro-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl]-N-isopropylamin.

15

HPLC: logP = 3,43

20

Analog Beispiel 1, sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

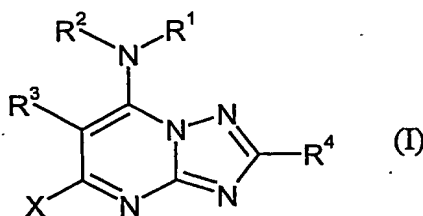


Tabelle 1

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
2	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-O-CH ₃	-Cl	3,26
3	2,2,2-Trifluor-1-methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-N(CH ₃) ₂	-Cl	3,52
4	i-Propylamino	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-N(CH ₃) ₂	-Cl	3,33
5	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	2,99
6	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O-CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,72
7	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,07
8	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,46
9	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,85
10	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,37
11	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,9
12	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	2,91
13	-CH ₃	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	2,67
14	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,1
15	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	3,68
16	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorphenyl	-Cl	-Cl	2,74
17	1-Cyclopropylethylamin o	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,55
18	-NH-CH ₂ -CF ₂ -CHF ₂	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,59
19	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,55
20	1-Cyclohexylethyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	
21	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	2,18
22	t-Butyl	-H	2-Chlorphenyl	-Cl	-Cl	3,99

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
23	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,87
24	-CH ₂ CH ₂ OH	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,23
25	t-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
26	-CH ₃	-CH ₃	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
27	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ - CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,03
28	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O- CH(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,81
29	-C ₂ H ₅	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,07
30	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,59
31	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,99
32	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,18
33	n-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,46
34	Cyclopentyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,03
35	2-Methoxyethyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,91
36	-CH ₃	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,7
37	Cyclopropyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
38	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ - CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,76
39	N-Morpholinyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	
40	Dimethylamino	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,18
41	-N(CH ₃)-COOCH ₃	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	2,55
42	Cyclohexyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,32
43	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,4
44	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	
45	-i-Propyl	-H	2-Chlorophenyl	-Br	-Cl	3,45

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
46	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	5
47	-i-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,36
48	-NH ₂	i-Butyl	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,67
49	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ - CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,03
50	-CH ₂ -CH(CH ₃)-O- CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,72
51	-C ₂ H ₅	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,07
52	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,5
53	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,9
54	n-Propyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,41
55	2-Methoxyethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	2,99
56	Cyclopropyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,14
57	N-Morpholinyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	2,77
58	t-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,9
59	-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,14
60	Cyclopentyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,94
61	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ - CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,72
62	Cyclopropylmethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,5
63	1-Cyclohexylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,92
64	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,76
65	-NH ₂	i-Butyl	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,67
66	-C(CH ₃) ₂ -CF ₃	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,28
67	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,28
68	-O-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,39

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
69	2-Methyl-butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,04
70	2-Butyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,79
71	-O-CH ₃	-CH ₃	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,36
72	-CH ₂ -CH ₂ - CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,19
73	2-Methyl-butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,05
74	2-Butyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,7
75	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,62
76	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	4,4
77	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,61
78	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,4
79	-CH ₂ -CH ₂ - CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	
80	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2,4-Difluor-6- methoxyphenyl	-O-CH ₃	-Cl	3,18
81	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,22
82	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,62
83	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ - CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,55
84	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	2,71
85	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,33
86	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,37
87	-CH ₂ -CH ₂ - CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,21
88	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,45

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
	CH(CH ₃)-CH ₂ -					
89	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,06
90	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,45
91	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	4,63
92	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,64
93	-CH ₂ -CH=C(C ₂ H ₅)- CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	4,87
94	-i-Propyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,42
95	-i-Propyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,31
96	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,52
97	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2-Chlorophenyl	-Cl	-Cl	3,63
98	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Cl	-Cl	3,58
99	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2,4,6-Trifluorophenyl	-Br	-Cl	3,59
100	2,2,2-Trifluor-1- methylethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,6
101	i-Butyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,61
102	2-Butyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,63
103	Cyclopentyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,79
104	2-Methoxyethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	2,82
105	Cyclopropyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,01
106	-CH ₂ -CF ₃	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,19

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
107	Cyclopropylmethyl	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,36
108	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,3
109	-CH(CH ₃)-CH ₂ - CH(CH ₃) ₂	-H	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,31
110	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	1,51
111	Propargyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,21
112	1,3-Dioxolan-2- ylmethyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,14
113	(2-Furyl)methyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,69
114	i-Butyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,08
115	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,2
116	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,98
117	-CH ₂ -CH ₂ -N(CH ₃) ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	1,65
118	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,3
119	Allyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,95
120	(2-Furyl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,98
121	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,87
122	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,51
123	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,61
124	n-Butyl	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,5
125	-C ₂ H ₅	-C ₂ H ₅	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,74
126	Cyclopropylmethyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,48
127	(2-Tetrahydrofuryl)methyl	n-Propyl	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,29

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
128	2-Methoxyethyl	n- Propyl	2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
129	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-		2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	3,78
130	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-		2,4-Difluorophenyl	-Cl	-Cl	4,27
131	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ - CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,73
132	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ - CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,02
133	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-		2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,92
134	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,54
135	2-Methoxyethyl	n- Propyl	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,06
136	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,51
137	Allyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,16
138	2-Methoxyethyl	-C ₂ H ₅	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,66
139	i-Butyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,74
140	2-Butyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,75
141	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,18
142	Cyclopentyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,9
143	Cyclopropylmethyl	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,49
144	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,4
145	-CH(CH ₃)-CH ₂ - CH(CH ₃) ₂	-H	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,43
146	Allyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,84
147	i-Butyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	4,29
148	2-Methoxyethyl	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorophenyl	-Cl	-Cl	3,32

Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
149	-CH ₂ -C(CH ₃)=CH ₂	-CH ₃	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,18
150	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-Cl	4,19
151	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,39
152	-NH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -		2,4,6-Trifluorphenyl	-N(CH ₃) ₂	-Cl	3,34
153	-CH ₂ -C(CH ₃) ₃	-H	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,05
154	-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,33
155	Allyl	-CH ₃	2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,7
156	-CH ₂ -CH(OH)-CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	2,33
157	-CH(CF ₃)-CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,09
158	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,43
159	-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH- CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,76
160	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,39
161	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,4
162	-CH ₂ -CH ₂ - CH=C(CH ₃)-CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,13
163	-CH ₂ -CH ₂ -CHF-CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,5
164	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CF ₃)- CH ₂ -CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4,07
165	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	4

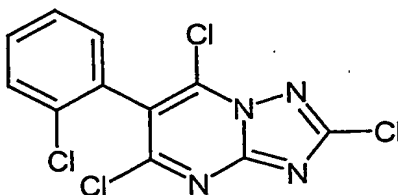
Bsp. Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	log.P*)
166	-CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	2,92
167	-CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₂ - CH ₂ -		2,4-Difluorphenyl	-Cl	-Cl	3,6
168	-CH ₂ -CF ₃	-H	2-Chlor-6-Fluorphenyl	-Cl	-Cl	3,25

steht für die Anknüpfungsstelle

*) Die Bestimmung der logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.
A8 durch HPLC (Gradientenmethode, Acetonitril/0,1 % wässrige Phosphorsäure)

Herstellung der Vorprodukte der Formel (II)

Beispiel (II-1)



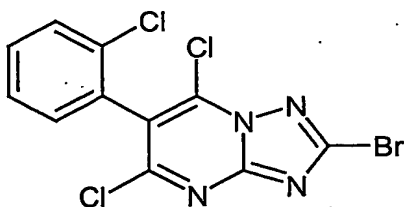
Verfahren b)

14,2 g rohes 2-Chlor-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on wird mit 63 g (0.41 mol) Phosphoroxychlorid versetzt. 5,5 g (26,4 mmol) Phosphorpentachlorid werden portionsweise dazu gegeben. Die Mischung wird 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Nach Abkühlen wird mit Wasser versetzt und 3 mal mit jeweils 100 ml Dichlormethan extrahiert. Das Produkt wurde säulenchromatographisch an Kieselgel mit Cyclohexan/Essigester (9:1) gereinigt. Man erhält 2,6 g (17 % der Theorie über 2 Stufen) 2,5,7-Trichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin.

HPLC: logP = 3,37

Analog wurden erhalten:

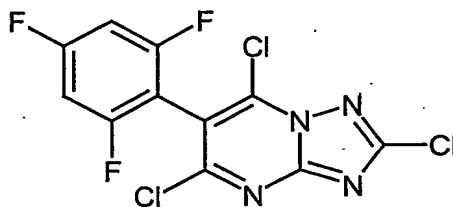
Beispiel (II-2)



2-Brom-5,7-dichlor-6-(2-chlorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

HPLC: logP = 3,39

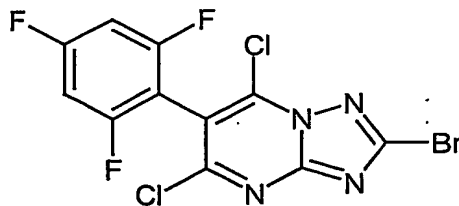
Beispiel (II-3)



2,5,7-Trichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

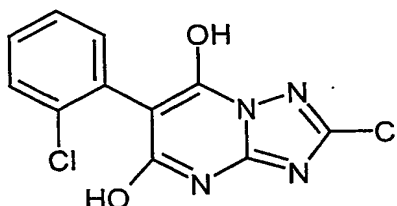
HPLC: logP = 3,28

Beispiel (II-4)



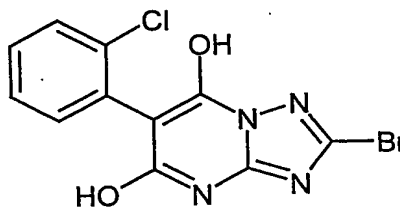
2-Brom-5,7-dichlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin

HPLC: logP = 3,27

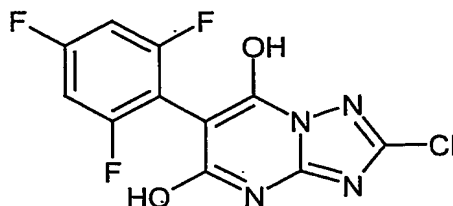
Herstellung der Vorprodukte der Formel (V)**Beispiel (V-1)**5 **Verfahren c)**

5,5 g (46,3 mmol) 5-Chlor-4H-1,2,4-triazol-3-ylamin, 11,2 g (46,3 mmol) Dimethyl-2-(2-chlorphenyl)malonat und 9,4 g (50,9 mmol) Tributylamin werden 16 Stunden bei 180°C gerührt. Das während der Reaktion entstehende Methanol wird kontinuierlich abdestilliert. Das Reaktionsgemisch wird im Hochvakuum eingengt. Man erhält 14,2 g rohes 2-Chlor-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on, das ohne weitere Reinigung im nächsten Reaktionsschritt eingesetzt wird.

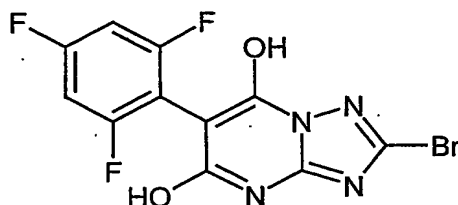
15 Analog wurden erhalten:

Beispiel (V-2)

20 2-Brom-6-(2-chlorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

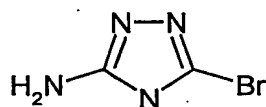


2-Brom-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

5 Beispiel (V-4)

2-Chlor-6-(2,4,6-trifluorphenyl)-7-hydroxy[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-5(4H)-on

10

Herstellung der Vorprodukte der Formel (VII)Beispiel (VII-1)

15

20

9,7 g (0,098 mol) Guanazol (1,2,4-Triazol-3,5-diamin) werden mit 180 ml (3,3 mol) Bromwasserstoffsäure versetzt und auf 0 bis 5°C abgekühlt. Unter Rühren wird bei dieser Temperatur eine Lösung bestehend aus 8,45 g (0,12 mol) Natriumnitrit in 20 ml Wasser langsam zugetropft. Die Reaktionsmischung wird langsam auf Raumtemperatur erwärmt und anschließend für 16 h rückflusiert. Zur Aufarbeitung wird die Reaktionslösung abgekühlt, auf ca. 1 l Eis gegeben und mit halbkonzentrierter

Natronlauge basisch gestellt. Die wässrige Lösung wird unter Vakuum auf ca. 500 ml aufkonzentriert und im flüssig-flüssig-Extraktor für mehrere Tage mit Essigester extrahiert. Nach Entfernen des organischen Lösungsmittels fallen 12,2 g 5-Brom-1,2,4-triazol-3-amin in 80 %iger Reinheit an (Ausbeute: 61 %).

5

HPLG: $\log P = 0,37$

Anwendungsbeispiele

Beispiel: A

5 Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauenerregers *Podosphaera leucotricha* inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

20

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

25

Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (97, 98) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von 98 % oder mehr.

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

- 5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator: 1,0 Gewichtsteile Alkyl-Aryl-Polyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubations-kabine.

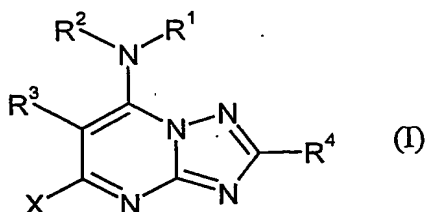
20 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

25 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Bei diesem Test zeigen die in den Beispielen (97, 98) aufgeführten erfindungsgemäßen Stoffe bei einer Aufwandmenge von 100 g/ha einen Wirkungsgrad von 98 % oder mehr.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel



in welcher

R¹ für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cyloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkinylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocyclyl steht, und

R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl oder Cycloalkyl steht, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

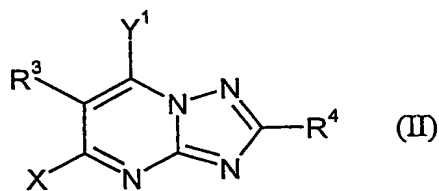
R³ für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

R⁴ für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und

X für Halogen steht, gefunden.

2. Verfahren zur Herstellung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man - Verfahren a) -

Dihalogen-triazolopyrimidine der allgemeinen Formel (II),

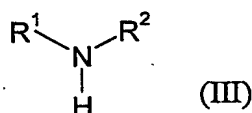


in welcher

R³, R⁴ und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

10 Y¹ für Halogen steht,

mit einem Amin der allgemeinen Formel (III),



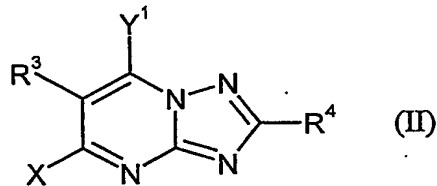
in welcher

R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors, umsetzt.

3. Mittel zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Triazolopyrimidin der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 25

4. Verwendung von Triazolopyrimidinen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.
5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die unerwünschten Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
6. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Triazolopyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
7. Dihalogen-triazolopyrimidine der Formel (II),

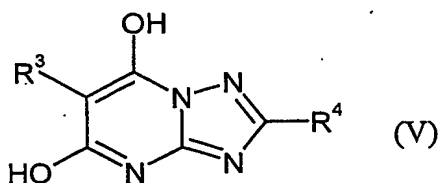


in welcher

R^3 , R^4 und X die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Y^1 für Halogen steht.

8. Verfahren zur Herstellung von Dihalogen-triazolopyrimidinen der Formel (II) gemäß Anspruch 7, dadurch gekennzeichnet, dass man - Verfahren b) - Dihydroxytriazolopyrimidine der Formel (V),



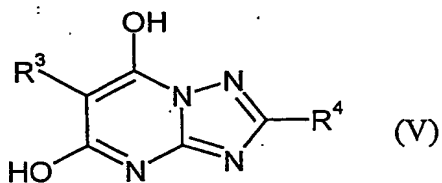
in welcher

R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Halogenierungsmitteln, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

9. Dihydroxy-triazolopyrimidine der Formel (V),



10

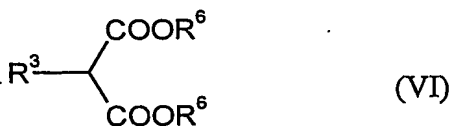
in welcher

R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

10. Verfahren zur Herstellung von Dihydroxy-triazolopyrimidinen der Formel (V) gemäß Anspruch 9, dadurch gekennzeichnet, dass man - Verfahren c) -

15

Arylmalonester der Formel (VI),



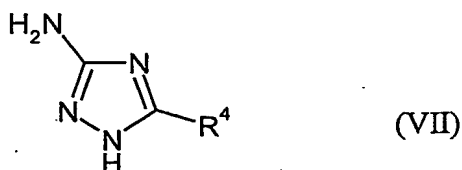
20

in welcher

R^3 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

R^6 für Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

5 mit Aminotriazolen der Formel (VII),

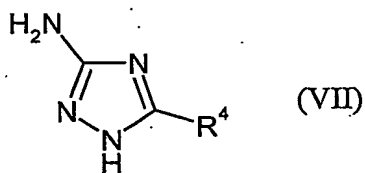


in welcher

10 R^4 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt.

15 11. Aminotriazole der Formel (VII),

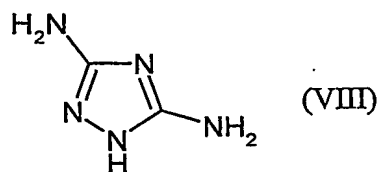


in welcher

20 R^4 für Cyan oder Brom steht.

12. Verfahren zur Herstellung von Aminotriazolen der Formel (VII) gemäß Anspruch 11, dadurch gekennzeichnet, dass man Diaminotriazol der Formel (VIII)

25

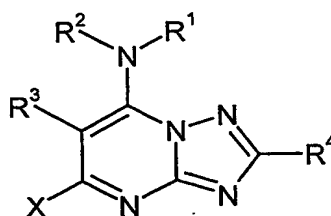


5 zunächst diazotiert und anschließend mit einem Bromierungsmittel, beispielsweise Bromwasserstoff bzw. mit Cyanierungsmitteln, beispielsweise Cyanwasserstoff, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart weiterer Reaktionshilfsmittel umgesetzt.

Triazolopyrimidine

Zusammenfassung

Neue Triazolopyrimidine der Formel



(I),

in welcher

R¹ für Amino, für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cyloalkyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Cycloalkyloxy, Alkylamino, Dialkylamino, Alkenylamino, Alkynylamino, Cycloalkylamino, N-Cycloalkyl-N-Alkylamino, Alkylidenamino oder Heterocyclyl steht,

5

R² für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl oder Cycloalkyl steht, oder

R¹ und R² gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten heterocyclischen Ring bilden,

10

R³ für gegebenenfalls einfach bis vierfach substituiertes Aryl steht,

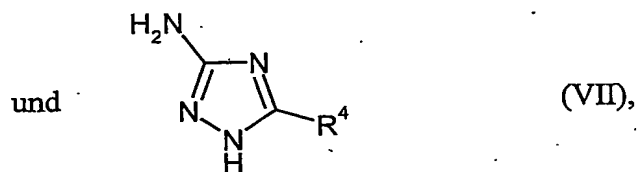
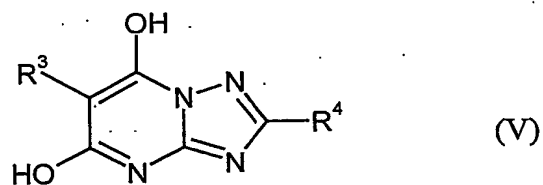
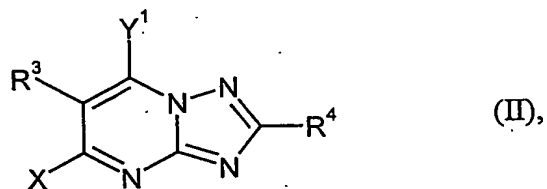
R⁴ für Halogen, Cyano oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkoxy oder Dialkylamino steht und

15

X für Halogen steht,

mehrere Verfahren zur Herstellung dieser neuen Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Neue Zwischenprodukte der Formeln



sowie Verfahren zu deren Herstellung.